

(51) Int. Cl.<sup>7</sup>:

(19) BUNDESREPUBLIK **DEUTSCHLAND** 



**DEUTSCHES** PATENT- UND **MARKENAMT** 

# **® Offenlegungsschrift**

<sub>®</sub> DE 198 30 211 A 1

(1) Aktenzeichen: ② Anmeldetag:

198 30 211.8 7, 7, 1998 13. 1.2000

(3) Offenlegungstag:

A 61 K 7/42 A 61 K 7/075

(71) Anmelder:

Kaden Biochemicals GmbH, 22113 Hamburg, DE

① Erfinder:

Widulle, Herbert, Dr., 22547 Hamburg, DE

#### Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen

Prüfungsantrag gem. § 44 PatG ist gestellt

- (54) Coffein-Chlorogensäure als Lichtschutzfilter
- **(57)** Vorliegendes Patent beschreibt die Verwendung von Coffein- und Theophyllin-Chlorogensäure-Salzen als wirksame Bestandteile in bestimmten kosmetischen Formulierungen (Cremes, Shampoos) zum Schutz vor Gewebeschäden durch den kurzwelligen Anteil des Sonnenlichts. 6 kosmetische Rezepturen werden als Beispiel auf-

#### Beschreibung

#### 1. Stand der Technik

Seit vielen Jahren ist Schutz der Haut vor den schädlichen Wirkungen von intensiver Sonneneinstrahlung ein wichtiges Thema in der Pharmazie und der Kosmetik. Während andere Themen in der Pharmazie oder in der Kosmetik immer mal wieder in der Wichtigkeit zurücktreten und dann wieder in den Vordergrund geschoben werden, ist dies bei den Hautschäden durch übermäßige Sonnenbestrahlung nicht der Fall. Seit es modern geworden ist, im Sommer eine tiefe Bräune im Gesicht zu tragen oder möglichst nahtlos am ganzen Körper braun zu sein, steigen die Zahlen der jährlichen Erkrankungen an Hautkrebs dramatisch an. So ist in Australien oder Kalifornien der Tod durch das maligne Melanom bei jungen Leuten mit die häufigste Todesursache. Auch bei uns dürfte die Todesrate durch das maligne Melanom bei Leuten, die sich jedes Jahr am Mittelmeer, Florida oder auf den Kanaren, um nur einige bekannte und häufig besuchte Ferienziele unter südlicher Sonne zu nennen, haben bräunen lassen, erheblich sein. Dies ist in einer früheren Anmeldung bereit beschrieben worden.

Zum zweiten hat sich gezeigt, daß die menschliche Haut durch intensive Sonnenbestrahlung vorzeitig altert. Es wäre also eigentlich wünschenswert, wenn die Menschen vollständig auf das Sonnenbaden verzichten würden. Dies ist aber unmöglich, da die Erfahrungen des letzten Jahrhundert gezeigt haben, daß ein vernünftiges Maß an Sonnenlicht auf der Haut vor Rachitis schützt und die Anfälligkeit für Tuberkulose mildern kann. Es wird deshalb versucht, mit chemischen Substanzen, die UV-Licht absorbieren, das Sonnenlicht in eine langweilige Wärmestrahlung umzuändern und so die positiven Effekte des Sonnenlichtes zu nutzen ohne die Haut für Hautkrebs anfälliger zu machen oder vorzeitig altem zu lassen. Zu diesem Zwecke werden hochdisperse Titandioxidpulver oder Zinkpulver verwendet. Wenn die Kristallgröße dieser Pulver ungefähr so groß ist wie die Wellenlänge des Lichtes, dann absorbieren sie das Sonnenlicht, ohne auf der Haut zu weißeln

Ein anderes Konzept ist die Verwendung von organischen Verbindungen mit mehrfach konjugierten Doppelbindungen. Diese Verbindungen absorbieren Licht im Bereich des nahen oder fernen UV und wandeln die eingefangene Energie in niedrigere um. Als Beispiele seien hier verschieden substituierte Zimtsäureverbindungen oder Campferderivate oder Dibenzoylmethane genannt. Sehr häufig verwendet werden z. B. Dimethoxyzimtsäuren. Die meisten dieser Verbindungen sind als allergen bekannt. Es bestehen deshalb Höchstgrenzen für die Verwendung von diesen Lichtschutzfiltern in Kosmetika. Um einen ausreichend hohen Lichtschutz unter Einhaltung dieser Höchstgrenzen zu erzielen, mischen viele Firmen mehrere verschiedene Lichtschutzfilter in ein Produkt. Auf diese Weise können sie die verschiedenen Absorptionsfilter so abmischen, daß das Spektrum des Sonnenlichtes optimal absorbiert wird. In der neueren Literatur ist offengelegt worden, daß natürliche Zimtsäure oder natürliche Derivate der Zimtsäure, wie zum Beispiel Chlorogensäure, als Lichtschutzfilter verwendet werden können. Leider sind die Verbindungen zwar sowohl im UVA- als auch im UVB-Bereich des Sonnenlichtes ausreichend absorptiv wirksam und sie sind auch nicht allergen, anders als die künstlichen Filter, aber sie sind nicht ausreichend stabil. Anders als die künstlichen Derivate der Zimtsäure, des Dibenzoylmethans oder der Campferderivate sind die natürlich vorkommenden Derivate der Zimtsäure, wie z.B. die Chlorogensäure, nicht ausreichend stabil und häufig bereits vor Gebrauch des Produktes durch Sauerstoff oder Licht zerstört. Leider hat sich gezeigt. daß die obigen künstlichen Sonnenschutzsysteme zwar ausreichend stabil sind und auch das kurzwellige Licht, das schnell zum Sonnenbrand führt, in längerwelliges umwandeln können, daß die Verbindungen aber anders als die natürlich vorkommenden Verbindungen als Nebenreaktion Peroxide erzeugen können. Der Gebrauch der Verbindungen in Kosmetika ist begrenzt, um das allergene und toxikologische Potential der UV-absorbierenden Verbindungen mit ihrer Vielzahl an konjugierten Doppelbindungen in vertretbaren Grenzen zu halten, damit die Produkte für den Sonnenschutz bei sachdienlichem und vorhersehbarem Gebrauch ohne Schaden für den Verwender benutzt werden können. Werden jetzt verschiedene Lichtschutzfilter derselben Verbindungsklassen miteinander kombiniert, so ist zwar dem Anhang der Kosmetikverordnung Genüge getan, das allergene Potential ist aber trotzdem zu hoch: Bei vielen dieser künstlichen Lichtschutzfilter besteht die Gefahr von kreuzweiser Sensibilisierung.

Auch bei dem normalen Sonnenbad ohne einen speziellen Lichtschutz entstehen in der Haut Peroxide. Peroxide können aber in der Haut z. B. die langkettigen Moleküle des Bindegewebes zerstören und so die Bildung von Falten fördern. Peroxide fördern aber auch körpereigene Abwehrstoffe, die von dem Immunsystem zur Abtötung von Bakterien verwendet werden. Die Bildung der Peroxide in der Haut beim Sonnenbad führt dann zur Zerstörung der Haut und zum Sonnenbrand.

In einer US- Patentschrift wird offenbart, daß es möglich ist, mit dimeren Gallussäuren Sonnenbrand zu lindern, indem die beim Sonnenbad gebildeten Peroxide durch die Gallussäuren zu Wasser reduziert werden. Die phenolischen Gallussäuren werden in Lösung gebracht und auf die Haut bei einem Sonnenbrand aufgetragen. Die Gallussäuren sollen dann in die Haut penetrieren und dort durch die Peroxide oxidiert werden, so daß die Peroxidasereaktion unterbrochen wird.

In den USA werden auch Cumarine als Sonnenschutzmittel verwendet. Diese Produkte sind zwar gute Lichtschutzfilter, aber toxikologisch nicht unbedenklich, da Cumarin eine toxische und allergene Substanz ist. Wünschenswert wäre die Verwendung von Substanzen als Sonnenschutzmittel, die nicht in der Pflanze als Abwehrstoffe, wie z. B. das Cumann, synthetisiert werden.

Seit ungefähr fünf Jahren wird Vitamin E, das Tocopherol, sowohl als Lichtschutzfilter und als entzündungshemmende Substanz in Kosmetika verwendet. Vitamin E ist aber nur in seiner natürlichen Konfiguration ausreichend wirksam, so daß das häufig angebotene künstliche dl-Tocopherol nicht ausreichend wirksam ist. Das natürliche Vitamin E ist gegenüber dem künstlichen Racemat achtfach wirksamer, da es aber ein Nebenprodukt der Öl- und Tensidherstellung aus Sojabohnen ist, ist die Menge, die erzeugt werden kann, begrenzt. Auch werden Sojabohnen weltweit in nennenswertem Umfang nur im Stromgebiet des Mississippi angebaut, so daß Unwetter auf einen Schlag eine ganze Jahresernte vernichten können.

In der Literatur wird beschrieben, daß es möglich ist, mit Flavonen, Flavonoiden oder Flavonolen die Peroxidasereaktion zu unterbrechen und damit zum Beispiel den Verlauf von allergischen Reaktionen zu beeinflussen. Als Beispiel sei

hier das Quercitrin erwähnt, daß als Begleitstoff in den Heidelbeerextrakten die pharmakologische Wirkung des Lebensmittelfarbstoffes sicherstellt.

Es besteht also ein großer Bedarf an Substanzen, die nicht toxisch und nicht allergen sind und die die Wirkung von UV- Licht auf die Haut mildern oder verhindern. Zum zweiten sollten die Verbindungen die Bildung von Sonnenbrand nach einer übermäßigen Bestrahlung und die Schädigung von Hautzellen durch Peroxide verhindern.

#### Beschreibung der Erfindung

Erstaunlicherweise und auch für den Fachmann völlig überraschend hat es sich gezeigt, daß es natürlich vorkommende Derivate der Zimtsäure gibt, die seit vielen Jahren bekannt sind, die UV- Licht in sichtbares Licht umwandeln können und auf diese Art Sonnenbrand verhindern können und die ausreichend stabil sind. Diese Verbindungen sind zum Zweiten auch noch in der Lage, Peroxide in Wasser umzuwandeln oder in Konkurrenz zu Peptiden der Haut Sauerstoff zu binden und so die Zerstörung von Peptidketten, z. B. der Polymere des Bindegewebes, zu verhindern. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also UV-Licht auf der Haut in längerwelliges Licht umwandeln, das ohne Schaden für die Haut absorbiert werden kann. Die Stoffe sind Verbindungen aus dem Sekundärstoffwechsel von Pflanzen und werden von der Pflanze zur Abwehr von zu großen Oxidationspotentialen oder zur Abwehr von Schäden durch Sonnenlicht synthetisiert. Die Verbindungen sind Salzbildungen zwischen natürlich vorkommenden Derivaten der Zimtsäure mit natürlich vorkommenden Stickstoffbasen wie z. B. Coffein, Theophillin, Cocain oder anderen Basen wie z. B. Xanthan, Harnstoff, Purin oder Allanthoin. Dabei sind stickstoffhaltige Basen, die aus Pflanzen gewonnen werden können, besonders bevorzugt. Ganz besonders bevorzugt sind Salze aus Coffeinsäure oder aus Derivaten der Coffeinsäure mit stickstoffhaltigen Basen, die in dieser Salzform in einer Pflanze vorkommen und die direkt gewonnen werden können. Als besonders bevorzugtes Beispiel werden natürlich vorkommende Chlorogensäuresalze mit stickstoffhaltigen Basen wie Coffein oder Theophillin genannt und als besonderes Beispiel Chlorogensäure-Coffeinsalz. Die erfindungsgemäßen Verbindungen werden aus Pflanzenteilen extrahiert. So kann z. B. das Coffeinsalz der Chlorogensäure aus den Blättern des grünen Tees gewonnen werden. Die erfindungsgemäßen Verbindungen werden mit Formel 1 beschrieben, in der

HOOC 
$$R_5$$

$$R_4$$

$$R_3$$

$$R_1$$

$$R_2$$

$$X$$

R1, R2, R3, R4 und R5 unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Hydroxygruppe oder eine Alkoxygruppe mit ein bis zwanzig Kohlenstoffatomen sind und der Ring 1 ein aromatischer Ring und der Ring 2 keine, eine oder zwei Doppelbindungen enthalten kann oder auch ein aromatischer Ring sein kann.

30

Bevorzugt sind aber Verbindungen, bei denen die Reste R1 und R2 Wasserstoffatome, Hydroxygruppen oder Alkoxygruppen mit nicht mehr als acht Kohlenstoffatomen sind und R3 ein Cyclohexylcarbonsäurerest, bei dem die Reste R3, R4 und R5 unabhängig voneinander für eine Wasserstoffatom, eine Hydroxygruppe oder ein Alkoxygruppe mit nicht mehr als acht Kohlenstoffatome bedeuten und der Ring maximal eine Doppelbindung enthält. Besonders bevorzugt sind Verbindungen bei denen R1, R2, R3, R4 und R5 für Hydroxygruppen stehen und der Ring zwei gesättigt ist. X steht in der Formel eins für eine Base, die durch das Proton der Carboxylgruppe der Cyclohexylsäure protoniert ist. Die Base ist bevorzugt eine natürlichen Ursprunges, es ist aber auch denkbar, aber nicht bevorzugt, künstlich hergestellte Basen zu verwenden. Als Base können z. B. verwendet werden: Morpholin, Ethylmorpholin, und andere N-alkylierte Morpholine, Oktylamin, Dicyclohexylmethylamin, Cyclohexylamin und N-alkylierte Cyclohexylamine, Purin, Creatinin, Xanthin, Allanthonin, Harnstoff, Coffein, Theophilin, Yohimbin, Cocain oder ein anderes Alkaloid, Bevorzugt ist aber die Verwendung von Coffein oder Theophilin. Dabei kann es hilfreich sein, eine Mischung von zweien oder mehreren Basen zu verwenden, da die Wahl der Base sowohl das Absorptionsspektrum als auch die Stabilität gegen Sauerstoff und Licht beeinflußt. Besonders bevorzugt sind Salze, bei denen die Base und die Säure in einer Pflanze als Komplex natürlich vorkommen und sich gegenseitig stabilisieren. Ein derartiger Komplex und besonders bevorzugt ist der Coffein-Chlorogensäurekomplex, der aus vielen Pflanzen durch Extraktion gewonnen werden kann. Bevorzugt ist aber die Gewinnung aus Rohkaffee oder grünem Tee. Dabei ist die Extraktion nicht im einzelnen vorgeschrieben. Denkbar ist zum Beispiel eine Extraktion mit reinem Alkohol, mit Aceton, Methylethylketon oder andere Lösemitteln, die auch halogenisiert sein können. Die Extraktion mit halogenierten Lösemitteln ist aber nicht bevorzugt, Besonders bevorzugt ist die Extraktion mit wäßrigen Systemen, z. B. wäßrigen Basen und anschließender Ausfällung und Umkristallisierung im neutralen bis leicht sauren pH- Bereich. Die erfindungsgemäße Verwendung der Stoffe soll im folgenden näher beschrieben werden:

#### 1. Beispiel Shampoo mit Schutz der Haare vor Schäden durch Sonnenlicht

Cocosfettethercarbonsäure	10,00	
Coffeinchlorogensäurekomplex	0,60	60
Cocoamidopropylbetain	3,00	
Natriumlaurylethersulfat	2,00	
Stabilisierungsmittel, Farbstoffe, Kochsalz, Parfüm tel quel, Natronlauge ad pH 6,5		
Wasser	ad 100	
		65

3

#### 2. Beispiel Shampoo mit Schutz der Haare vor Schäden durch Sonnenlicht

	Cocosfettethercarbonsäure	10,00
_	Chlorogensäure	0,40
5	Cocoamidopropylbetain	3,00
	Natriumlaurylethersulfat	2,00
	Stabilisierungsmittel, Farbstoffe, Kochsalz, Parfüm tel quel, Natronlauge ad pH 6.5	
	Wasser	ad 100

10

Die beiden Rezepturen unterscheiden sich nur darin, daß im Beispiel 1 ein Chlorogensäure-Coffeinsalz und im Beispiel 2 eine äquivalente Menge an reiner Chlorogensäure verarbeitet worden ist. Als Stabilisierungsmittel werden je 0,5 Prozent Ascorbinsäure und Zitronensäure verwendet. Die Produkte werden in dünnwandigen Flaschen aus PE, Natur, dem Sonnenlicht ausgesetzt. Nach 4 Wochen ist die Probe mit der reinen Chlorogensäure graugrünlich verfärbt, die Probe mit dem Coffein-Chlorogensäuresalz ist noch hellgelb, wie bei der Herstellung.

#### 3. Beispiel Sonnenschutzcreme, O/W

20	Paraffinum liquidum Theophilin-Chlorogensäuresalz	15,00 6,00
	Sorbitanstearinsäureester	*
		4,50
	Sucrosecocoat	1,00
	Stabilisierungsmittel, Farbstoffe, Parfüm tel quel,	,
	Wasser	ad 100
25		
	4. Beispiel Sonnenschutzereme, O/W	
	1	

Paraffinum liquidum	15,00
Chlorogensäure	4,00
Sorbitanstearinsäureester	4,50
Sucrosecocoat	1,00
Stabilisierungsmittel, Farbstoffe, Parfüm tel quel,	•
Wasser	ad 100
	Chlorogensäure Sorbitanstearinsäureester Sucrosecocoat Stabilisierungsmittel, Farbstoffe, Parfüm tel quel,

35

## 5. Beispiel Sonnenschutzcreme, O/W

	Paraffinum liquidum	15,00
40	Sorbitanstearinsäureester	4,50
	Sucrosecocoat	1,00
	Stabilisierungsmittel, Farbstoffe, Parfüm tel quel,	·
	Wasser	ad 100

45

Die drei Rezepturen unterscheiden sich nur darin, daß im Beispiel 3 ein Chlorogensäure-Theophilinsalz, im Beispiel 4 eine äquivalente Menge an reiner Chlorogensäure verarbeitet worden ist und Beispiel 5 das Plazebo ist. Als Stabilisierungsmittel werden je 0,5 Prozent Na-Ascorbat und Na-Citrat verwendet.

Während die Creme mit der reinen Chlorogensäure nach zwei Wochen Lagerung im Sonnenlicht in einem PE- Behältnis deutliche Verfärbungen zeigte und die Chlorogensäure zersetzt war, war die Emulsion des Beispiels 3 mit Coffeinchlorogensäuresalz bei gleichen Lagerbedingungen unverändert. Die Empfindlichkeit des Chlorogensäure-Coffeinsalzes ist also gegenüber der freien Säure deutlich vermindert.

Eine freiwillige Person trug auf den rechten Arm zwei gr Emulsion nach Beispiel 5 auf und auf den linken zwei gr Emulsion nach Beispiel 3. Bei Exposition dem Sonnenlicht zeigte sich ein deutlicher Schutz vor Sonnenbrand durch die Behandlung mit Emulsion nach Beispiel 3 im Vergleich zu dem Placebo 5.

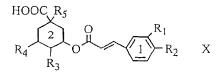
## 6. Beispiel

	Ethanol, den.	98,00
60	Coffeinchlorogensäuresalz	1,00
	Neutralöl	1,00

Das Produkt nach Beispiel 6 wurde 12 Monate lang in weißem Glas dem Sonnenlicht ausgesetzt. Die originale gelbliche Färbung blieb vorhanden.

#### Patentansprüche

1. Sonnenschutzmittel zum Auftragen auf die Haut, dadurch gekennzeichnet, daß es der Formel 1 entspricht,



in der R1, R2, R3, R4 und R5 unabhängig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Hydroxygruppe oder eine Alkoxygruppe mit ein bis zwanzig Kohlenstoffatomen bedeuten und der Ring 1 ein aromatischer Ring und der Ring 2 keine, eine oder zwei Doppelbindungen enthalten oder auch ein aromatischer Ring sein kann und X in der Formel eins für eine Base steht.

2. Sonnenschutzmittel zum Auftragen auf die Haut nach Anspruch 1, dadurch ausgezeichnet, daß der Ring 2 keine Doppelbindung enthält und R5 eine Hydroxy- oder eine Alkoxygruppe bedeutet.

3. Sonnenschutzmittel zum Auftragen auf die Haut oder die Haare nach den Ansprüchen eins und zwei, dadurch ausgezeichnet, daß die Reste R1, R2, R3, R4 und R5 unabhängig voneinander eine Hydroxygruppe, ein Wasserstoffatom oder eine Methoxygruppe sind.

4. Sonnenschutzmittel zum Auftragen auf die Haut oder die Haare nach den Ansprüchen eins bis drei, dadurch ausgezeichnet, daß X eine stickstoffhaltige Base ist.

5. Sonnenschutzmittel zum Auftragen auf die Haut oder die Haare nach den Ansprüchen eins bis vier, dadurch ausgezeichnet, daß die Base X aus der Gruppe von Morpholin, Ethylmorpholin, Oktylamin, Dicyclohexylmethylamin, Cyclohexylamin, Ethylcyclo-hexylamin, Purin, Xanthin, Allantoin, Atropin, Harnstoff, Coffein, Theophilin, Yohimbin und Cocain ausgewählt ist.

6. Sonnenschutzmittel zum Auftragen auf die Haut oder die Haare nach den Ansprüchen eins bis fünf, dadurch ausgezeichnet, daß die Base X eine natürlich Base aus der Gruppe Purin, Xanthin, Allantoin, Atropin, Harnstoff, Coffein, Theophilin, Yohimbin und Cocain ausgewählt ist.

7. Sonnenschutzmittel zum Auftragen auf die Haut oder die Haare nach den Ansprüchen eins bis sechs, dadurch ausgezeichnet, daß es das erfindungsgemäße Salz Coffeinhydrochlorogensäure ist.

8. Sonnenschutzmittel zum Auftragen auf die Haut oder die Haare nach den Ansprüchen eins bis sieben, daß es das erfindungsgemäße Salz in einer Konzentration zwischen 0,2 und 20 Prozent enthält.

9. Sonnenschutzmittel zum Auftragen auf die Haut oder die Haare nach den Ansprüchen eins bis acht, dadurch ausgezeichnet, daß es vor einer Bestrahlung mit UV-Licht oder mit Licht mit UV-Anteilen auf die Haut oder die Haare aufgetragen wird.

10. Sonnenschutzmittel zum Auftragen auf die Haut oder die Haare nach den Ansprüchen eins bis sieben, dadurch ausgezeichnet, daß es nach einer Bestrahlung mit UV-Licht oder mit Licht mit UV-Anteilen auf die Haut oder die Haare aufgetragen wird.

40

5

20

25

30

35

45

50

60

55

65

0010379960 Drawing available WPI Acc no: 2000-137909/200013 XRAM Acc no: C2000-042495

## Sunscreens for protection of hair and skin against UV

Patent Assignee: KADEN BIOCHEMICALS GMBH (KADE-N)

Inventor: WIDULLE H

Patent Family (1 patents, 1 countries)							
Patent Number	Kind	Date	Application Number	Kind	Date	Update '	Туре
DE 19830211	A1	20000113	DE 19830211	A	19980707	200013	В

Priority Applications (no., kind, date): DE 19830211 A 19980707

Patent Details					
Patent Number	Kind	Lan	Pgs	Draw	Filing Notes
DE 19830211	A1	DE	5	0	

## **Alerting Abstract DE A1**

NOVELTY - Sunscreens for application to the skin are salts of naturally occurring cinnamic acid derivatives (especially chlorogenic acid) with (preferably naturally occurring) bases such as caffeine, theophylline or cocaine.

DESCRIPTION - Sunscreens for skin application comprise compounds of formula (I):

HOOC 
$$R_5$$

$$R_4$$

$$R_3$$

$$R_3$$

$$R_2X$$
(I)

 $R_1 - R_5 = H$ , OH or 1 - 20C alkoxy;

ring 1= an aromatic ring;

ring 2= a ring with 0, 1 or 2 double bonds or can also be an aromatic ring; and X= a base

USE - Application to the skin or hair for protection from UV, e.g. in protecting from sunburn and from the effects of peroxides.

ADVANTAGE - The compounds are nontoxic and non-allergenic; they are readily obtained as plant extracts, e.g. the chlorogenic acid/caffeine salt is obtained from green tea leaves.

## **Technology Focus**

ORGANIC CHEMISTRY - Preferred Compounds: Compounds for application to the skin have

ring 2 with no double bonds and  $R_5 = H$  or alkoxy, and compounds for application to either the skin or hair have  $R_1 - R_5 = H$ , OH or MeO, while X in either case is a N-base, preferably morpholine, Et morpholine, octylamine, dicyclohexylamine, cyclohexylamine, Et cyclohexylamine or especially one of the following natural bases: purine, xanthine, allantoin, atropine, urea, caffeine, theophylline, yohimbine or cocaine. An especially preferred compound for application to both hair and skin is the caffeine salt of chlorogenic acid in a concentration of 0.2-20%.

Title Terms /Index Terms/Additional Words: PROTECT; HAIR; SKIN; ULTRAVIOLET

## **Class Codes**

International Patent Classification						
IPC	Class Level	Scope	Position	Status	Version Date	
A61K-007/42			Main		"Version 7"	
A61K-007/075			Secondary		"Version 7<	

File Segment: CPI DWPI Class: D21; E14

Manual Codes (CPI/A-N): D08-B03; D08-B09A; D09-E; E06-D01; E06-D09; E07-D09D; E07-

E03; E10-A13B2

#### **Chemical Indexing**

```
Chemical Fragment Codes (M3):
*01* M905 M904 G010 G012 G013 G015 G030 G033 G034 G036 G037 G038 G039 G111
     G561 G562 G563 G599 H102 H161 H181 H541 H542 H561 H562 H563 H712 H721
     J011 J151 J581 M126 M132 M210 M211 M212 M213 M214 M215 M216 M220 M221
     M222 M223 M224 M225 M226 M231 M232 M233 M240 M272 M273 M280 M281 M282
     M283 M311 M320 M321 M342 M343 M372 M373 M391 M414 M510 M520 M530 M531
    M540 M541 M542 M620 M650 M770 0012-21601-K 0012-21601-M
*02* M905 M904 C101 C106 C107 C108 C800 C801 C802 C807 F012 F014 F015 F523
     G010 G012 G013 G015 G030 G033 G034 G036 G037 G038 G111 G561 G562 G563
    H541 H542 H561 H562 H563 H712 H721 J011 J151 J522 J581 L432 L910 M210
    M211 M212 M213 M214 M215 M216 M220 M221 M222 M223 M224 M225 M226 M231
    M232 M233 M240 M272 M280 M281 M282 M283 M311 M320 M321 M342 M372 M391
    M411 M413 M510 M520 M521 M530 M531 M540 M541 M650 M770 0012-21602-K
     0012-21602-M
*03* M905 M904 D000 D011 D013 D015 D931 D932 G010 G012 G013 G015 G030 G033
     G034 G036 G037 G038 G111 G561 G562 G563 H181 H201 H212 H541 H542 H561
     H562 H563 H712 H721 J011 J151 J522 J581 L910 M210 M211 M212 M213 M214
     M215 M216 M220 M221 M222 M223 M224 M225 M226 M231 M232 M233 M240 M272
    M273 M280 M281 M282 M283 M311 M320 M321 M342 M372 M391 M412 M510 M511
    M520 M530 M531 M540 M541 M650 M770 0012-21603-K 0012-21603-M
*04* M905 M904 D011 D013 D014 D670 G010 G012 G013 G015 G030 G033 G034 G036
     G037 G038 G100 G111 G561 G562 G563 H181 H201 H401 H481 H541 H542 H561
     H562 H563 H712 H721 J0 J011 J012 J151 J211 J221 J581 M210 M211 M212
    M213 M214 M215 M216 M220 M221 M222 M223 M224 M225 M226 M231 M232 M233
    M240 M272 M273 M280 M281 M282 M283 M311 M312 M321 M332 M342 M343 M371
    M372 M391 M412 M510 M511 M520 M531 M540 M541 M650 71943 0012-21604-K
     0012-21604-M
*05* M905 M904 F000 F014 F653 G010 G012 G013 G015 G030 G033 G034 G036 G037
    G038 G111 G561 G562 G563 H181 H201 H541 H542 H561 H562 H563 H712 H721
```

```
J011 J151 J581 M210 M211 M212 M213 M214 M215 M216 M220 M221 M222 M223 M224 M225 M226 M231 M232 M233 M240 M272 M273 M280 M281 M282 M283 M311 M320 M321 M342 M372 M391 M413 M510 M520 M521 M530 M531 M540 M541 M650 0012-21605-K 0012-21605-M
```

Ring Index Numbers: (Linked) 71943

Generic (Markush) Compound Numbers: 0012-21601-K; 0012-21601-M; 0012-21602-K; 0012-21602-M; 0012-21603-K; 0012-21603-M; 0012-21604-K; 0012-21604-M; 0012-21605-K; 0012-21605-M; 0012-21602-CL; 0012-21603-CL; 0012-21601-CL; 0012-21604-CL; 0012-21605-CL Key Word Indexing

\*1\* 0012-21602-CL 0012-21603-CL 0012-21601-CL 0012-21604-CL 0012-21605-CL

# **Original Publication Data by Authority**

# Germany

Publication No. DE 19830211 A1 (Update 200013 B)

Publication Date: 20000113

Coffein-Chlorogensaure als Lichtschutzfilter

Assignee: Kaden Biochemicals GmbH, 22113 Hamburg, DE (KADE-N)

Inventor: Widulle, Herbert, Dr., 22547 Hamburg, DE

Language: DE (5 pages, 0 drawings)

Application: DE 19830211 A 19980707 (Local application)

Original IPC: A61K-7/42(A) A61K-7/075(B) Current IPC: A61K-7/42(A) A61K-7/075(B)

Original Abstract:

Vorliegendes Patent beschreibt die Verwendung von Coffein- und Theophyllin-Chlorogensaure-Salzen als wirksame Bestandteile in bestimmten kosmetischen Formulierungen (Cremes, Shampoos) zum Schutz vor Gewebeschaden durch den kurzwelligen Anteil des Sonnenlichts. 6 kosmetische Rezepturen werden als Beispiel aufgeführt.

## Claim:

• 1. Sonnenschutzmittel zum Auftragen auf die Haut, **dadurch gekennzeichnet**, dass es der Formel 1 entspricht,

[CHE 0008.0001]

in der R1, R2, R3, R4 und R5 unabhangig voneinander ein Wasserstoffatom, eine Hydroxygruppe oder eine Alkoxygruppe mit ein bis zwanzig Kohlenstoffatomen bedeuten und der Ring 1 ein aromatischer Ring und der Ring 2 keine, eine oder zwei Doppelbindungen enthalten oder auch ein aromatischer Ring sein kann und X in der Formel eins für eine Base steht.